PCT

WELTORGANISATION FUR GEISTIGES EIGENTUM

Internationales Büro



(51) Internationale Patentklassifikation 7:

C07K 7/06, 7/08, C12N 15/10, A61K 38/04, A61P 7/02

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer:

WO 00/37487

A1

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum:

29. Juni 2000 (29.06.00)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP99/09842

(22) Internationales Anmeldedatum:

11. Dezember 1999

(11.12.99)

(30) Prioritätsdaten:

198 58 587.7

19. Dezember 1998 (19.12.98) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter Strasse 250, D-64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DIEFENBACH, Beate [DE/DE]; Friedrich-Ebert-Platz 19, D-64289 Darmstadt (DE). JONCZYK, Alfred [DE/DE]; Schepp-Allee 57, D-64295 Darmstadt (DE). KRAFT, Sabine [DE/DE]; Giselherstrasse 8, D-65668 Rimbach (DE). MEHTA, Ray [IN/GB]; MRC Collaborative Centre, 1-3 Bustanhole Lane, Mill London NW7 IAD (GB). 19.100,
- (74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH; Frankfurter Strasse 250, D-64293 Darmstadt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RÓ, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europaisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.

(54) Title: $\alpha_{\nu}\beta_{b}$ INTEGRIN INHIBITORS

(54) Bezeichnung: INHIBITOREN DES INTEGRINS $\alpha_{\nu}\beta_{6}$

(57) Abstract

The invention relates to novel peptides which are biologically active as ligands of $\alpha_{\nu}\beta_{6}$ integrin. Said peptides have a common structural motif, i.e. Asp Leu Xaa Leu - or in a preferred form Arg Xaa Asp Leu Xaa Xaa Leu Arg-, wherein Xaa represents any amino acid radical. The peptides according to the invention can be used as efficient $\alpha_v \beta_6$ integrin receptor inhibitors and consequently in the treatment of different diseases and pathologies.

(57) Zusammenfassung

Die Erfindung beschreibt neuartige Peptide, welche als Liganden des Integrins $\alpha \sqrt{\beta_6}$ biologisch wirksam sind. Diese Peptide weisen alle ein gemeinsames Strukturmotiv, namlich - Asp Leu Xaa Leu -, bzw. in einer bevorzugten Form - Arg Xaa Asp Leu Xaa Xaa Leu Arg - auf, wobei Xaa für einen beliebigen Aminosaurerest steht. Die erfindungsgemäßen Peptide können als wirksame Inhibitoren des $\alpha\sqrt{\beta}$ 6-Integrin-Rezeptors und somit zur Behandlung verschiedener Krankheiten und pathologischer Befunde eingesetzt werden.